



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 26. August 2004 (26.08.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2004/072023 A3

(51) Internationale Patentklassifikation7: C07D 327/06, A01N 43/84

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/001053

(22) Internationales Anmeldedatum:

5. Februar 2004 (05.02.2004)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

103 06 244.0 14. Februar 2003 (14.02.2003) DE 103 21 270.1 13. Mai 2003 (13.05.2003) DE

- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789 Monheim (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). RIECK, Heiko [DE/FR]; 9, rue Claude Monet, F-69110 Ste Foy les Lyon (FR). GREUL, Nico, Jörg [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrückerstr. 61, 41470 Neuss (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a,

40764 Langenfeld (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Färberstr. 1, 40223 Langenfeld (DE).

- (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents and Licensing, Kaiser-Wilhelm-Allee, 51368 Leverkusen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TI, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- (88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 7. April 2005

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

- (54) Title: OXATHIIN CARBOXAMIDE
- (54) Bezeichnung: OXATHIINCARBOXAMIDE

$$G^{3} \longrightarrow G^{1} \longrightarrow G^{1} \longrightarrow G^{1} \longrightarrow G^{2} \longrightarrow G^{1} \longrightarrow G^{1$$

- (57) Abstract: The invention relates to the novel oxathiin carboxamide of formula (I), wherein G^1 , G^2 , G^3 , n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 and Z are defined as in the description. The invention also relates to several methods for producing these substances and their use for controlling undesired microorganisms, and to novel intermediates and their production.
- (57) Zusammenfassung: Neue Oxathiincarboxamide der Formel (I), in welcher G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und Z die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.



International Application No. PCT/EP2004/001053

A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER 1PC 7 CO7D327/06 A01N43/84

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) . IPC 7-A01N-C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUM	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °			
Catefory	Citation of document, with indication. where appropriate, of	the relevant passages	Relevant to claim No.
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthe trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiincarboxani their fungicidal activity" HAN'GUK NONGHWA HAKHOECHI, 4 CODEN: JKACA7; ISSN: 0368-289	lides and 4(3) 191-196	1
	XP009038028		
х	examples 18,19,40,41,52,53; to Abstract	able 1	
^	ADSTRACT		1-16
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthe: trifluoromethylated		1
	dihydro-1,4-oxathiin-3-carboxathrough polymer-bound activate	od ester"	
1	HETEROCYCLES , 48(11), 2253-22 HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1998, page 2253, last paragraph; exa	XPAAQAXAA22	
ĵ	page 2200; rast paragraph; exc	unple 2	Ì
		-/	
	or documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family members are listed in	n annex.
Special cate	egories of cited documents:	"T" Interdegment out to be about	
COMPLIE	t defining the ganeral state of the an which is not red to be of particular relevance cument but published on or after the international	"I later document published after the Inte of priority date and not in conflict with clied to understand the principle or the invention	iory organising the
document which is cliation	which may throw doubts on priority claim(s) or clied to establish the publication date of another or other special reason (as specified) I referring to an oral disclosure, Use. exhibition or	"X" document of particular relevance; the creamot be considered novel or cannot involve an inventive step when the document of particular relevance; the creamot be considered to involve an involve a	Alment is taken alono
document	ans published prior to the International filing date but the priority date claimed	cannot be considered to involve an involve document is combined with one of moments, such combination being obvious in the art.	s to a person skilled
ate of the ac	rual completion of the international search	*&" document member of the same patent for Date of mailing of the international sear	•
13	October 2004	1 1. 01. 05	or ruggert
an dan em	iling address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk	Authorized officer	
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl. Fax: (+31-70) 340-3016	Goss, I	



International Application No PCT/EP2004/001053

C.(Continu	BILON) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	70172720047001055
Category "	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18 April 1972 (1972-04-18) cited in the application the whole document	1-16
(EP 0 545 099 A (BASF AG) 9 June 1993 (1993-06-09) page 28 - page 31; table 8	1-16

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheat) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/EP2004/001053

Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)
to the state of th
This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
1. Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. Claims Nos.; because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international Search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Fluie 6.4(a).
Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 3 of first sheet)
This international Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
see additional sheet
1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
A. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1-16
Remark on Protest The additional search fees were accompanied by the applicant's protest. No protest accompanied the payment of additional search fees.

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1-16

Oxathiincarboxamide der Formel (I), Verfahren zu deren Herstellung und Verwendung zur Bekämpfung von Mikroorganismen

1.1. claim: 17

Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) als Zwischenprodukte

2. claim: 18

Anilin-Derivaten der Formel (III) als Zwischenprodukte

ERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No PCT/EP2004/001053

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
US 3657449	A	18-04-1972	CA	942189	A1	19-02-1974
EP 0545099	A	09-06-1993	AT	149487	T	15-03-1997
			ΑU		B2	27-01-1995
			AU	2855492	A	27-05-1993
			CA	2081935 /	A1	23-05-1993
			CZ		A3	13-10-1993
			CZ		B6	16-01-2002
			DE		D1	10-04-1997
			DK	545099	T3	24-03-1997
			EP	054 5 099 A	42	09-06-1993
			E\$	2098421	T3	01-05-1997
			GR	3023336	T3	29-08-1997
			Hυ	62861 A	42	28-06-1993
			IL	103614 A	4	24-09-1998
			JP	3202079 E	32	27-08-2001
			JP	5221994 A	4	31-08-1993
			JP	2001253802 A	4	18-09-2001
			JP	2001316210 A	A	13-11-2001
			KR		31	16-10-2000
			NZ	245194 A	4	27 - 02- 19 96
			PL		41	18-10-1993
			SK	344892 A	43	08-03-1995
			US	5480897 A		02-01-1996
			US	5556988 A		17-09-1996
			US	5589493 A		31-12-1996
			US	5330995 A	-	19-07-1994
			ZA	9208977 A	4	19-05-1994
	~~~-					

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D327/06 A01N43/84

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

#### B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchlerter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole )  $1PK \ 7 \quad A01N \quad C07D$ 

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data -

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	5-4-4
	Social many der veronen menden generation unter Angabe der in Betracht kommenden gene	Betr. Anspruch Nr.
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiincarboxanilides and their fungicidal activity" HAN'GUK NONGHWA HAKHOECHI, 44(3), 191-196	1
Y	CODEN: JKACA7; ISSN: 0368-2897, 2001, XP009038028 Beispiele 18,19,40,41,52,53; Tabelle 1 Abstract	1.16
^		1-16
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiin-3-carboxanilides through polymer-bound activated ester" HETEROCYCLES, 48(11), 2253-2261 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1998, XP009038022 Seite 2253, letzter Absatz; Beispiel 2	1

**************************************	
Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	X Siehe Anhang Patentfamille
<ul> <li>Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</li> <li>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</li> </ul>	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeidedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeidung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der
*E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist	Erfindung zugrundellegenden Prinzips oder der ihr zugrundellegenden Theorie angegeben ist  'X' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung
scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belent werden.	kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden  "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung die beanspruchte Erfindung
ausgeführt)  "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen, Anmeldedatum, aber nach	verbilentiating von besondere Beteilung, die beanspruchte Emindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahellegend ist  *&* Veröffentlichung, die Mitglied derseiben Patentfamilie ist
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts
13. Oktober 2004	¥_1_ 01, 2005
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevolimächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo ni, Fax: (+31–70) 340–3016	Goss, I



internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/001053

	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden	Felle Betr. Anspruch Nr.
х	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18. April 1972 (1972-04-18) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-16
x	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9. Juni 1993 (1993-06-09) Seite 28 - Seite 31; Tabelle 8	1-16

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT



Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recharabie bewert.
Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt
Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:
1. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr. well es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.
Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)
Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:
siehe Zusatzblatt
Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. Da der Anmelder nur einlge der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recher-chenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen er-faßt:  1-16
Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs  Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

**WEITERE ANGABEN** 

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-16

Oxathiincarboxamide der Formel (I), Verfahren zu deren Herstellung und Verwendung zur Bekämpfung von Mikroorganismen

1.1. Anspruch: 17

Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) als Zwischenprodukte

2. Anspruch: 18

Anilin-Derivaten der Formel (III) als Zwischenprodukte

## INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/001053

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokum	ent	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 3657449	A	18-04-1972	CA	942189 A1	19-02-1974
EP 0545099	Α	09-06-1993	AT	149487 T	15-03-1997
			ΑU	656243 B2	27-01-1995
			ΑU	2855492 A	27-05-1993
			CA	2081935 A1	23-05-1993
			CZ	9203448 A3	13-10-1993
			CZ	289478 B6	16-01-2002
			DE	59208113 D1	10-04-1997
			DK	545099 T3	24-03-1997
			ΕP	0545099 A2	09-06-1993
			ES	2098421 T3	01-05-1997
			GR	3023336 T3	29-08-1997
			HU	62861 A2	28-06-1993
			IL	103614 A	24-09-1998
			JP	3202079 B2	27-08-2001
			JP	5221994 A	31-08-1993
			JP	2001253802 A	18-09-2001
			JP	2001316210 A	13-11-2001
			KR	267518 B1	16-10-2000
			NZ	245194 A	` 27-02-1996
			PL	296677 A1	18-10-1993
			SK	344892 A3	08-03-1995
			US	5480897 A	02-01-1996
			US	5556988 A	17-09-1996
			US	5589493 A	31-12-1996
			US	5330995 A	19-07-1994
			ZA	9208977 A	19-05-1994